

- For more records, click the Records link at page end.
- To change the format of selected records, select format and click Display Selected.
- To print/save clean copies of selected records from browser click Print/Save Selected.
- To have records sent as hardcopy or via email, click Send Results.

<input checked="" type="checkbox"/> Select All			Format
<input checked="" type="checkbox"/> Clear Selections	Print/Save Selected	Send Results	Display Selected Free

1. ☐ 3/5/1 DIALOG(R)File 352:Derwent WPI (c) 2004 Thomson Derwent. All rts. reserv.

010790683

WPI Acc No: 1996-287636/199630

XRAM Acc No: C96-092046

Synergistic combination for treating unclear skin - contains  
e.g. salicylic acid and/or an alpha-hydroxy carboxylic acid and/or an  
alpha-ketocarboxylic acid

Patent Assignee: BEIERSDORF AG (BEIE )

Inventor: CHRISTIANSEN M; SCHOENROCK U; STEINKE S; TRAUPE B; WOLF F

Number of Countries: 011 Number of Patents: 005

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
DE 444237	A1	19960620	DE 444237	A	19941213	199630 B
EP 721775	A2	19960717	EP 95118408	A	19951123	199633
JP 8225439	A	19960903	JP 95345016	A	19951208	199645
EP 721775	A3	19961218	EP 95118408	A	19951123	199707
DE 444237	C2	20000824	DE 444237	A	19941213	200041

Priority Applications (No Type Date): DE 444237 A 19941213

Cited Patents: No-SR.Pub: 2.Jnl.Ref: AU 448095; EP 556660; EP 587288; EP 596135; EP 7785; US 4380549; US 5411734; US 5420106; WO 9406440

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
DE 444237	A1	20	A61K-007/40		
EP 721775	A2 G	23	A61K-007/48		

Designated States (Regional): AT BE CH DE ES FR GB IT LI NL

JP 8225439 A 15 A61K-007/48

EP 721775 A3 A61K-007/40

DE 444237 C2 A61K-007/40

Abstract (Basic): DE 444237 A

A cosmetic and/or dermatological active ingredient combination consists of (a) an effective amt. of salicylic acid and/or one or more alpha-hydroxy carboxylic acids and/or one or more alpha-ketocarboxylic acids; (b) one or more substances chosen from monoglycerine monocarboxylic acid monoesters, diglycerine monocarboxylic acid monoesters and triglycerine monocarboxylic acid monoesters; (c) opt. an effective amt. of retinol and/or derivs. of retinol.

USE - The combination can be used against unclear skin and mild forms of acne. The combination is effective against Propioni-bacterium acnes.

ADVANTAGE - The combinations are synergistic.

Dwg. 0/0

Title Terms: SYNERGISTIC; COMBINATION; TREAT; UNCLEAR; SKIN; CONTAIN;

SALICYLIC; ACID; ALPHA; HYDROXY; CARBOXYLIC; ACID; ALPHA; ACID

Derwent Class: B05; D21; E19

International Patent Class (Main): A61K-007/40; A61K-007/48

International Patent Class (Additional): A61K-007/00; A61K-007/42;

A61K-031/07; A61K-031/19; A61K-031/215; A61K-031/60

File Segment: CPI

Derwent WPI (Dialog® File 352): (c) 2004 Thomson Derwent. All rights reserved.

BEST AVAILABLE COPY

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平8-225439

(43) 公開日 平成8年(1996)9月3日

(51) Int.Cl. <sup>8</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 7/48 7/00			A 6 1 K 7/48 7/00	C Y W
31/07			31/07	

審査請求 未請求 請求項の数 3 F D (全 15 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平7-345016

(22) 出願日 平成7年(1995)12月8日

(31) 優先権主張番号 P 4 4 4 4 2 3 7. 8

(32) 優先日 1994年12月13日

(33) 優先権主張国 ドイツ (D E)

(71) 出願人 591010376

バイヤースドルフ・アクチエンゲゼルシャ  
フト

BEIERSDORF AKTIENGE  
SELLSCHAFT

ドイツ連邦共和国デー-2000ハンブルク  
20・ウンナシユトラーセ48

(72) 発明者 ウベ・シエンロツク

ドイツ・デー-22844ノルデルシユテット・  
マルガリテンベーク 8

(74) 代理人 弁理士 小田島 平吉

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 斑点のある皮膚、軽症の形態のアクネ及びグラム陽性菌に対して活性な、活性化化合物配合物

(57) 【要約】

【課題】 斑点のある皮膚又はアクネに対して活性な配  
合物の提供。

【解決手段】 a) 活性量のサリチル酸及び／又は活性  
量の、1種類以上の $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸類及び／  
又は活性量の、1種類以上の $\alpha$ -ケトカルボン酸類、  
b) モノグリセロールモノカルボン酸モノエステル類、  
ジグリセロールモノカルボン酸モノエステル類及びトリ  
グリセロールモノカルボン酸モノエステル類からなる群  
から選ばれる、1種類以上の物質及び

c) 適当な場合には、活性量の、レチノール及び／又は  
レチノール誘導体類を含んでなる、化粧品及び／又は皮  
膚科学的活性化化合物配合物。

1

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 化粧品及び／又は皮膚科学的活性化合物配合物であって、

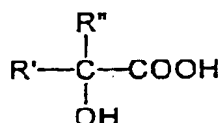
a) 活性量のサリチル酸及び／又は活性量の、1種類以上の $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸及び／又は活性量の、1種類以上の $\alpha$ -ケトカルボン酸、

b) モノグリセロールモノカルボン酸モノエステル類、ジグリセロールモノカルボン酸モノエステル類及びトリグリセロールモノカルボン酸モノエステル類、からなる群から選ばれる1種類以上の物質及び

c) 適当な場合には、活性量の、レチノール及び／又はレチノール誘導体を含んでなる配合物。

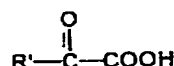
【請求項2】 前記 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸もしくは $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸類が、一般式

【化1】



の物質からなる群から選ばれること及び、前記 $\alpha$ -ケトカルボン酸もしくは $\alpha$ -ケトカルボン酸類が、一般式

【化2】

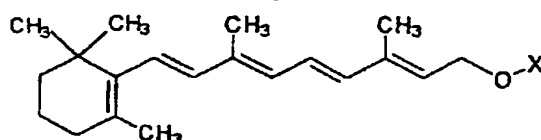


の物質からなる群から選ばれることを特徴とし、上記式中、 $R'$  及び $R''$  はたがいに独立してそれぞれ、(a 1) H-、(a 2) 分枝又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル-、(a 3) 1個以上の、カルボキシル基及び／又はヒドロキシル基及び／又はアルデヒド基及び／又はオキシ基(ケト基)により置換されている、分枝又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル-、(a 4) フェニル-、(a 5) 1個以上の、カルボキシル基及び／又はヒドロキシル基及び／又は分枝及び／又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル基により置換されているフェニル-か、あるいはここで、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸の $\alpha$ -炭素原子が、 $R'$  及び $R''$  と一緒になって、(a 6) 3から7個の環原子をもつ非置換シクロアルキル基を形成するフェニル-か、又は(a 7) 3から7個の環原子をもち、そして1個以上の、カルボキシル基及び／又はヒドロキシル基及び／又はオキシ基(ケト基)及び／又は分枝及び／又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル基により置換されており、そしてここで、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸もしくは $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸類又は $\alpha$ -ケトカルボン酸もしくは $\alpha$ -ケトカルボン酸類は、場合によっては、それらの生理学的に許容性のある塩類及び／又はエチルエステル類及び／又はメチルエステル類の形態であることができる、請求項1による活性化合物配合物。

【請求項3】 前記レチノール誘導体が、以下の構造

【化3】

2



式中、Xは好適には、1から25個のC原子をもつ、分枝又は非分枝の、アルキル基又はアルケニル基であるの物質からなる群から選ばれることを特徴とする、請求項1による活性化合物配合物。

10 【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、斑点のある皮膚に対して活性である、活性化合物及びそれらの活性化合物を含んでなる調製物に関する。

【0002】

【従来の技術】その他の影響とならんで、バクテリアによる二次感染症は、斑点のある皮膚の症例において病原学的に重要である。斑点のある皮膚に関連して、最も重要な微生物の一つはアクネプロピオン酸菌(*Propionibacterium acnes*)である。

【0003】斑点のある皮膚及び／又はにきびは、たとえ軽症の場合でも、それらの患者の福利を損なう。実際的にはすべての青年が、ある程度の斑点のある皮膚にかかるため、多くの患者でこの症状を治療する必要がある。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】従って、本発明の目的は、斑点のある皮膚又はアクネプロピオン酸菌に対して活性な物質又は物質の配合物を見いだすことにある。

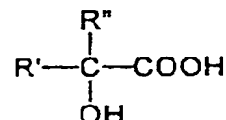
【0005】

【課題を解決するための手段】驚くべきことに、

a) 活性量のサリチル酸及び／又は活性量の、1種類以上の一般式

【0006】

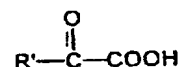
【化4】



【0007】の $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸及び／又は活性量の、1種類以上の一般式

【0008】

【化5】



【0009】の $\alpha$ -ケトカルボン酸であって上記式中、 $R'$  及び $R''$  は互いに独立してそれぞれ、(a 1) H-、(a 2) 分枝又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル-、(a 3) 1個以上の、カルボキシル基及び／又はヒドロキシル基及び／又はアルデヒド基及び／又はオキシ基(ケト

基)により置換されている、分枝又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル、(a4)フェニル、(a5)1個以上の、カルボキシル基及び/又はヒドロキシル基及び/又は分枝及び/又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル基、により置換されているフェニルか、あるいはここで、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸の $\alpha$ -炭素原子が、R'及びR"と一緒に、(a6)3から7個の環原子をもつ非置換シクロアルキル基を形成するフェニルか、又は(a7)3から7個の環原子をもち、そして1個以上の、カルボキシル基及び/又はヒドロキシル基及び/又はオキシ基

(ケト基)及び/又は分枝及び/又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル基により置換されており、そしてここで、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸もしくは $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸類又は $\alpha$ -ケトカルボン酸もしくは $\alpha$ -ケトカルボン酸類は、場合によっては、それらの生理学的に許容性のある塩類及び/又はエチルエステル類及び/又はメチルエステル類の形態であることができる、からなる群から選ばれるものである、

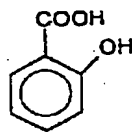
b) モノグリセロールモノカルボン酸モノエステル類、ジグリセロールモノカルボン酸モノエステル類及びトリ

グリセロールモノカルボン酸モノエステル類からなる群から選ばれる1種類以上の物質及び  
c) 適当な場合には、活性量の、レチノール及び/又はレチノール誘導体、を含んでなる、化粧品及び/又は皮膚科学的の活性化化合物配合物は、従来の当該技術分野の欠点を是正することが見いだされ、そしてそれにより本目的が達成される。

【0010】サリチル酸(2-ヒドロキシ安息香酸又はスピリル酸も)は下記の構造。

【0011】

【化6】



【0012】により特定される。

【0013】既知のように、サリチル酸は抗菌作用及び角質溶解作用をもち、そして一定の化粧品又は医薬品調製物の成分である。

【0014】本発明による $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸は好都合には、以下の分類の物質から選ばれる：

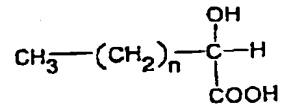
(a2) $\alpha$ -ヒドロキシー脂肪酸、これらは順次、特に好都合には、 $C_{10-18}$ -アルキルカルボン酸、(a3) $\alpha$ -ヒドロキシー糖酸及び脂肪酸 $\alpha$ -ヒドロキシー果実酸、(a4)非置換芳香族 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸(例えばマンデル酸)及び(a5)置換芳香族 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸、からなる群から選ばれる。

【0015】(a2)の項に入る $\alpha$ -ヒドロキシー脂肪酸は特に好都合には、

— 式

【0016】

【化7】

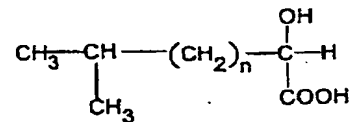


【0017】による、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸及び/又は

— 式

【0018】

【化8】

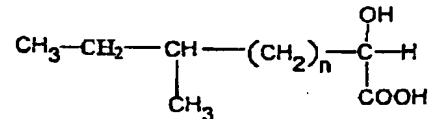


【0019】による、 $\alpha$ -ヒドロキシイソカルボン酸及び/又は

— 式

【0020】

【化9】



【0021】 $\alpha$ -ヒドロキシーアンテイソカルボン酸からなる群から選ばれ、上記各式中、nはそれぞれ7から31の数字である。

【0022】本発明に関連して、 $C_{16}$ 物質である、すなわち $\alpha$ -炭素原子上に分枝又は非分枝 $C_{14}H_{29}$ 鎖をもつ $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸を使用することが、特に好都合である。

【0023】これらの脂肪酸 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸の混合物を、特に、その $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸の含量が組成物の総量の20-30重量%である、羊毛ワックス酸混合物の形態で使用することが更に好都合である。

【0024】(a3)の項に入る $\alpha$ -ヒドロキシ糖酸は

— アルドン酸、例えばグルコン酸及びガラクトン酸

— アルダル酸、例えばグルカル酸及びガラクトアル酸

(及び又、同様にアルダル酸の定義下に入る果実酸酒石酸)

— ウロン酸、例えばグルクロン酸及びガラクトツロン酸

— グリセリン酸

からなる群から、特に好都合に選ばれる。

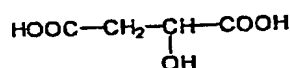
【0025】(a3)の項に入る脂肪酸 $\alpha$ -ヒドロキシ果実酸は、リンゴ酸、乳酸、クエン酸及び酒石酸からなる群から、特に好都合に選ばれる。

【0026】リンゴ酸(ヒドロキシコハク酸)は以下の

50 化学構造

【0027】

【化10】



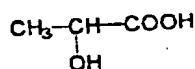
【0028】で特定される。

【0029】乳酸(2-ヒドロキシプロパン酸)は以下

の化学構造

【0030】

【化11】

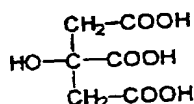


【0031】で特定される。

【0032】クエン酸(2-ヒドロキシ-1, 2, 3-プロパントリカルボン酸)は以下の化学構造

【0033】

【化12】

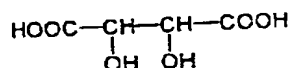


【0034】で特定される。

【0035】既知のように、クエン酸は化粧品及び／又は皮膚科学的調製物の緩衝用に、そして又皮膚及び毛髪用化粧品中の抗酸化剤のための相乗剤としても使用される。酒石酸(ジヒドロキシコハク酸)は以下の化学構造

【0036】

【化13】



ヘキサン酸(カプロン酸)

ヘプタン酸(エナント酸)

オクタン酸(カプリル酸)

ノナン酸(ペラルゴン酸)

デカン酸(カプリン酸)

ウンデカン酸

ドデカン酸(ラウリン酸)

トリデカン酸

テトラデカン酸(ミリスチン酸)

である。

【0045】Rは、特に好都合には、オクタノイル基(カプリル酸基)又はデカノイル基(カプリン酸基)、すなわち、式

$$\text{R} = -\text{C}(\text{O})-\text{C}_7\text{H}_{15} \quad \text{又は} \quad \text{R} = -\text{C}(\text{O})-\text{C}_9\text{H}_{19}$$

により表される基である。

【0046】本明細書において、特に実施例において、GMCyの略語は、モノカプリル酸グリセロールに、GMCの略語はモノカプリン酸グリセロールに使用される。

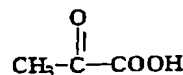
【0047】グリセロールの1-位においてエステル化

【0037】で特定される。

【0038】好適な $\alpha$ -ケトカルボン酸はピルビン酸( $\alpha$ -オキソプロパン酸)である。それは以下の構造

【0039】

【化14】



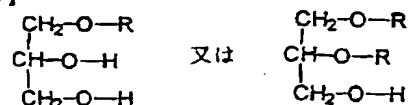
【0040】で特定される。

10 【0041】驚くべきことに、それら自体は任意の成分、モノグリセロール、ジグリセロール及び／又トリグリセロールモノカルボン酸(類)も又更に、同様に相乗的な態様で、レチノールの、 $\alpha$ -ヒドロキシ酸及び／又は $\alpha$ -ケトカルボン酸との相乗作用を増加させることが見いだされた。

【0042】本発明によるモノグリセロールモノカルボン酸モノエステル類は次の構造

【0043】

【化15】



【0044】式中、Rは6-14の炭素原子をもつ、分枝又は非分枝アシル基であるにより表される。Rは好都合には、非分枝アシル基からなる群から選ばれる。これらのエステル類が基礎とする脂肪酸又はモノカルボン酸類は、

(R = -C(O)-C<sub>5</sub>H<sub>11</sub>)、(R = -C(O)-C<sub>6</sub>H<sub>13</sub>)、(R = -C(O)-C<sub>7</sub>H<sub>15</sub>)、(R = -C(O)-C<sub>8</sub>H<sub>17</sub>)、(R = -C(O)-C<sub>9</sub>H<sub>19</sub>)、(R = -C(O)-C<sub>10</sub>H<sub>21</sub>)、(R = -C(O)-C<sub>11</sub>H<sub>23</sub>)、(R = -C(O)-C<sub>12</sub>H<sub>25</sub>)、(R = -C(O)-C<sub>13</sub>H<sub>27</sub>)

されているグリセロールエステルの場合には、2-位が不斉中心である。2S及び2R配置は、本発明において活性で、同等に好都合である。

【0048】立体異性体類のラセミ混合物を使用することが好都合であることが証明されている。

【0049】皮膚科学的調製物中のGMCy及び／又はGMCの含量は好都合には、それぞれ具体的な調製物の総重量を基にして、0.1-10.0重量%、好適には0.5-7.5重量%、特に好適には1.5-5.0重量%である。

【0050】本発明によると、本発明のジグリセロールモノカルボン酸モノエステル類又はトリグリセロールモ

7

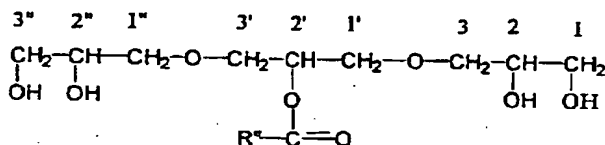
ノカルボン酸モノエステル類のジ-又はトリグリセロール単位は、線状の非分枝状分子、すなわち1-又は3-位で特定のOH基を介してエステル化されている、「モノグリセロール」の形態にある。

【0051】少量の、環状のジ-又はトリグリセロール単位及び、2-位でOH基を介してエステル化されているグリセロール分子は許容できる。しかし、このような不純物はできるだけ少なく保つことが好都合である。

【0052】本発明によるモノカルボン酸モノエステル類は、好適には、下記の構造（置換位置が示される）

【0053】

【化16】



【0057】式中、R'' は炭化水素基、好都合には、5から17のC原子をもつ、分枝又は非分枝の、アルキル

ヘキサン酸（カプロン酸）  
 heptan酸（エナント酸）  
 オクタン酸（カプリル酸）  
 ノナン酸（ペラルゴン酸）  
 デカン酸（カブリン酸）  
 ウンデカン酸  
 10-ウンデセン酸（ウンデシレン酸）  
 ドデカン酸（ラウリン酸）  
 トリデカン酸  
 テトラデカン酸（ミリスチン酸）  
 ペンタデカン酸  
 ヘキサデカン酸（パルミチン酸）  
 ヘプタデカン酸（マルガリン酸）  
 オクタデカン酸（ステアリン酸）

である。

【0059】R' 及びR'' は、特に好都合には、奇数のC数の、特に9、11及び13個のC原子をもつ非分枝アルキル基からなる群から選ばれる。

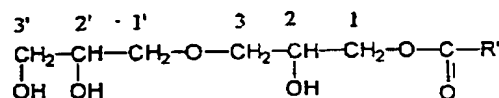
モノカブリン酸ジグリセロール  
 モノラウリン酸トリグリセロール  
 モノラウリン酸ジグリセロール  
 モノミリスチン酸トリグリセロール

である。

【0062】モノカブリン酸ジグリセロール（DMC）は本発明による好適なジグリセロールモノカルボン酸モノエステルであることが証明された。

【0063】本発明によるジグリセロールモノカルボン酸モノエステルは、好適には1-位でエステル化された形態にあり、そして、本発明によるトリグリセロールモノ-脂肪酸エステルは好適には、2'-位でエステル化された形態にある。

8



【0054】式中、R' は炭化水素基、好都合には、5から17のC原子をもつ、分枝又は非分枝の、アルキル又はアルケニル基であるで特定される。

【0055】本発明によるトリグリセロールモノカルボン酸エステル類は好適には、下記の構造（置換位置が示される）

【0056】

【化17】

又はアルケニル基であるで特定される。

【0058】これらのエステル類が基礎とする酸は、

(R' 又はR'' = -C<sub>5</sub>H<sub>11</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>6</sub>H<sub>13</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>7</sub>H<sub>15</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>8</sub>H<sub>17</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>9</sub>H<sub>19</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>10</sub>H<sub>21</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>10</sub>H<sub>19</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>11</sub>H<sub>23</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>12</sub>H<sub>25</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>13</sub>H<sub>27</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>14</sub>H<sub>29</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>15</sub>H<sub>31</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>16</sub>H<sub>33</sub>)、  
 (R' 又はR'' = -C<sub>17</sub>H<sub>35</sub>)

【0060】ジグリセロールのモノカルボン酸モノエステル類は一般的にトリグリセロールのモノカルボン酸モノエステル類よりも好適である。

【0061】特に好適なエステル類は、

(DMC) R' = 9  
 (TML) R'' = 11  
 (DML) R' = 11  
 (TMM) R'' = 13

【0064】本発明の好都合な態様によると、その他の位置でエステル化されているジ-もしくはトリグリセロールの更なる成分、及び又場合によってはジ-もしくはトリグリセロールの種々のジエステル類の成分も使用される。

【0065】ドイツ特許出願公開第38 18 293号明細書に記載されたような方法により得ることができる、これらのモノカルボン酸エステルは特に好都合である。2個の不斉中心の特徴をもつジグリセロールエステ

ル類及び、3個の不斉中心の特徴をもつトリグリセロールエステル類は、すべてのそれらの配置において、本発明において活性である。該ジグリセロールエステル類は4種の立体異性体を持ち、そしてトリグリセロールエステル類は8個の立体異性体をもつ。

【0066】ジグリセロールエステルにおいては、2-及び2'-位が不斉中心である。

【0067】2S2'S、2R2'S、2S2'R及び2R2'Rの配置が、本発明において活性であり、同等に好都合である。

【0068】トリグリセロールエステルにおいては、2-、2'及び2''-位が不斉中心である。2S2'S2''S、2R2'S2''S、2S2'R2''S、2R2'R2''S、2S2'S2''R、2R2'S2''R、2S2'R2''R、及び2R2'R2''R配置が本発明において活性であり同等に好都合である。

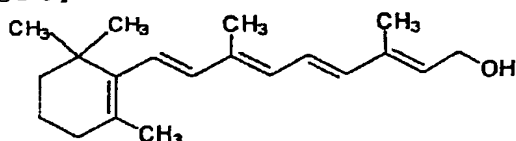
【0069】それらの立体異性体のラセミ混合物を使用することが好適であることが示された。

【0070】本発明による調製物は、特に好都合には、それらのモノカルボン酸エステル又はジ-及び/又はトリグリセロールのエステルが、それぞれ該組成物の総重量の、0.01-10.00重量%、好適には0.05-5.00重量%、特に好適には0.1-3.00重量%の濃度で存在することを特徴とする。

【0071】レチノールは以下の構造

【0072】

【化18】



【0073】で特定される。

【0074】レチノール(又:アキセロフトール;

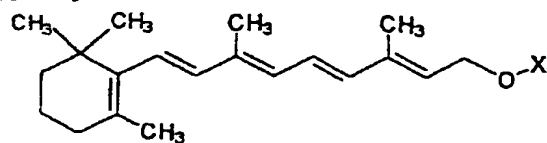
[3, 7-ジメチル-9-(2, 6, 6-トリメチル-1-シクロヘキセニル)-2, 4, 6, 8-ノナテトラエン-1-オール])は、ビタミンA<sub>1</sub>と同義語であり、そして誘導体のレチン-1-カルボン酸(ビタミンA酸、レチノイン酸、トレチノイン)の同類であり、そしてそのエステル類又はレチン-1-オール(ビタミンAアルデヒド)も又、時々ビタミンAアルコールと呼ばれる。

【0075】レチノールはアクネ治療剤として知られている。

【0076】本発明によると、レチノールエステル類はそれら自体で、又はそれらのたがいの配合剤として、又は非エステル化レチノールとの配合剤としても、本発明による活性化化合物配合剤中で同様に好都合に使用することができる。本発明によるレチノールエステル類は好適には次の構造

【0077】

【化19】



【0078】式中、Xは好適には、1から25個のC原子をもつ、分枝又は非分枝の、アルキル又はアルケニル基であるで表わされる。パルミチン酸レチノール(=パルミチン酸レチニル)が好適には、そのレチノールエステルとして選ばれる。

【0079】化粧品及び/又は皮膚科用の使用に適しているかあるいは従来使用されているすべての抗酸化剤は、好適な、しかし任意に使用されるべき抗酸化剤として本発明により使用することができる。

【0080】それらの抗酸化剤は、好都合には、アミノ酸(例えば、グリシン、ヒスチジン、チロシン及びトリプトファン)及びそれらの誘導体、イミダゾール類(例えばウロカニン酸)及びそれらの誘導体、D、L-カルノシン、D-カルノシン、L-カルノシン及びそれらの誘導体(例えばアンセリン)のようなペプチド類、カロテノイド類、カロテン類(例えば、 $\alpha$ -カロテン、 $\beta$ -カロテン及びリコピン)及びそれらの誘導体、リボン酸(liponic acid)及びその誘導体(例えばジヒドロリボン酸)、アウロチオグルコース、プロピルチオウラシル及びその他のチオール類(例えば、チオレドキシン、グルタチオン、システイン、シスチン、シスタミン並びにそれらの、グリコシル、N-アセチル、メチル、エチル、プロピル、アミル、ブチル及びラウリル、パルミトイル、オレイル、 $\gamma$ -リノレイル、コレステリル及びグリセリルエステル)及びそれらの塩、チオジプロピオン酸ジラウリル、チオジプロピオン酸ジステアリル、チオジプロピオン酸及びその誘導体(エステル、エーテル、ペプチド、脂質、ヌクレオチド、ヌクレオシド及び塩)並びにスルホキシイミン化合物(例えば、ブチオニ-スルホキシイミン類、ホモシステイン-スルホキシイミン、ブチオニ-スルホン類並びにペンター、ヘキサ-及びヘプタチオニ-スルホキシイミン)を非常に少量の許容される用量(例えば $\mu\text{mol}$ から $\mu\text{mol}/\text{kg}$ )で、そして更に、(金属の)キレート化剤(例えば $\alpha$ -ヒドロキシ脂肪酸、パルミチン酸、フィチン酸又はラクツフェリン)、 $\alpha$ -ヒドロキシ酸(例えば、クエン酸、乳酸及びリンゴ酸、フミン酸、胆汁酸、胆汁抽出物、ビリルビン、ビリベルジン、EDTA、EGTA及びそれらの誘導体、不飽和脂肪酸及びそれらの誘導体(例えば、 $\gamma$ -リノレン酸、リノール酸及びオレイン酸)、葉酸及びその誘導体、ユビキノン及びユビキノール及びそれらの誘導体、ビタミンC及び誘導体(例えばパルミチン酸アスコルビル、リン酸アスコルビルMg及び酢酸アスコルビ

ル)、トコフェロール類及び誘導体(例えば酢酸ビタミンE)、ベンゾインレジンの安息香酸コニフェリル、ルチン酸(rutic acid)及びその誘導体、フェルラ酸及びその誘導体、ブチル化ヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、ノルジヒドロゲアヤク脂酸、ノルジヒドロゲアヤレチン酸、トリヒドロキシブチロフェノン、尿酸及びその誘導体、マンノース及びその誘導体、亜鉛及びその誘導体(例えば $ZnO$ 及び $ZnSO_4$ )、セレン及びその誘導体(例えばセレン-メチオニン)、スチルベン及びその誘導体(例えば酸化スチルベン及びトランス-酸化スチルベン)並びに本発明により適切な、前記のこれらの活性化合物の誘導体(塩、エステル、エーテル、糖、ヌクレオチド、ヌクレオシド、ペプチド及び脂質)からなる群から選ばれる。

【0081】該調製物中の抗酸化剤(1種類以上の化合物)の量は、その調製物の総重量に基づいて、好適には0.001から30重量%、特に好適には0.05から20重量%、なかんずくは1から10重量%である。

【0082】ビタミンE及び/又はその誘導体が抗酸化剤(類)である場合には、それらの具体的な濃度は、その調製物の総重量を基にして0.0001から10重量%の範囲から選ばれることは都合が良い。

【0083】高度の必要条件をもつ化粧品組成物は通常、従来の補助剤及び添加剤なしには思いもよらないことは当該技術分野の専門家にはもちろん知られている。これらは例えば、コンシステンシーを与える物質、充填剤、香料、染料、乳化剤、ビタミン類もしくは蛋白質類のような追加的活性化合物、光線防御剤、安定化剤、抗酸化剤、昆虫忌避剤、アルコール、水、塩類、抗微生物作用、蛋白分解作用又は角質溶解作用をもつ物質等を含む。

【0084】本発明による調製物に緩衝物質を添加することは特に好都合である。その調製物がpH5.5以下に緩衝される場合は特に好都合である。

【0085】従って、本発明による組成物は、それらの組成によって、例えば皮膚保護クリーム、クレンジング乳液、日焼けローション、栄養クリーム、日中用もしくは夜間用クリーム等、として使用されることができる。適当な場合には、本発明による組成物を医薬用調製物の基剤として使用することは可能であり、そして好都合である。

【0086】本発明は又、これらの活性化合物配合物の、皮膚の保護用化粧品及び/又は皮膚科学的調製物への使用にも関する。

【0087】使用に際し、本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は、化粧品としての従来の方法で、適量で皮膚に投与される。

【0088】本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は、例えばこの種類の調製物に通常使用されているような、種々の形態にすることができる。従って、それらは

例えば、溶液、油中水タイプ(W/O)もしくは水中油タイプ(O/W)の乳剤、又は例えば水中油中水タイプ(W/O/W)の複合乳剤、ゲル剤、固形スティック又は更にエアゾールにもすることができる。

【0089】本発明に関連して、本発明による活性化合物配合物を、皮膚の清浄用の、水性系又は界面活性剤調製物に混合することも又、可能であり、そして好都合である。

【0090】本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は、このような調製物に通常使用されるような化粧品補助剤、例えば、保存剤、殺菌剤、香料、発泡抑制剤、染料、着色性をもつ顔料、増粘剤、界面活性物質、乳化剤、柔軟剤、増湿剤及び/又は保湿剤、脂肪、油、ワックス又は、アルコール、ポリオール、ポリマー、気泡安定剤、電解質、有機溶媒又はシリコン誘導体のような、化粧品又は皮膚科学的調製物のその他の従来の成分、を含んでなることができる。

【0091】該化粧品又は皮膚科学的調製物が溶液又はローションである場合は、使用されることができる溶媒は：

—水又は水溶液

—カプリン酸又はカプリル酸のトリグリセリドのような油、しかし好適にはヒマシ油；

—脂肪、ワックス及びその他の天然に存在する及び合成の脂肪物質、好適には低C数のアルコール、例えば、イソプロパノール、プロピレングリコール又はグリセロール、と脂肪酸のエステル、あるいは脂肪酸アルコールと、低C数のアルカン酸又は脂肪酸と脂肪酸アルコールとのエステル；

—低C数のアルコール、ジオール又はポリオール、及びそれらのエーテル、好適にはエタノール、イソプロパノール、プロピレングリコール、グリセロール、エチレングリコール、エチレングリコールモノエチルもしくはモノブチルエーテル、プロピレングリコールモノメチル、モノエチルもしくはモノブチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルもしくはモノエチルエーテル及び類似製品、である。

【0092】前記の溶媒の混合物が特に使用される。水はアルコール性溶媒の追加的成分にすることができる。

【0093】例えば皮膚保護クリーム、皮膚ローション又は化粧品乳液の形態の、例えば日焼け止めクリーム又は日焼け止め乳液の形態の、本発明による乳剤は好都合でありそして、例えば、脂肪、油、ワックス及びその他の前記の脂肪物質、並びに水及びこのタイプの調製物に通常使用される乳化剤を含んでなる。

【0094】本発明による調製物は又、好適にはゲル剤の形態を取ることができ、それらは、本発明による活性化合物配合物及びこの目的に通常使用される溶媒に加えて、通常、低C数のアルコール、例えばエタノール、イソプロパノール、1,2-プロパンジオール、グリセロ



ール、及び水、あるいは前記の油、並びに又有機増粘剤、例えばアラビアゴム、キサンタンゴム、アルギン酸ナトリウム、セルロース誘導体、好適にはメチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース又はヒドロキシプロピルメチルセルロース、又は無機の増粘剤、例えば二酸化ケイ素及び／又はケイ酸アルミニウム（例えば、ベントナイトのような）、又はポリエチレングリコール及びポリエチレングリコールステアラートもしくはジステアラートの混合物を含んでなる。ゲル剤は、例え

10

ば、0.1と30重量%の間、好適には0.5と15重量%の間の量の増粘剤又は増粘剤類を含んでなる。

【0095】本発明による固体スティックは例えば、天然に存在するかあるいは合成のワックス、脂肪酸アルコール又は脂肪酸エステルを含んでなる。

【0096】エアゾール容器から噴霧することができる、本発明による化粧品及び／又は皮膚科学的調製物に適した噴射剤は、従来からの、既知の、揮発しやすい、液化噴射剤、例えば、それら自体でも又は互いの混合物としても使用することができる炭化水素（プロパン、ブタン、イソブタン）である。圧縮された空気も又好都合に使用されることができる。

20

【0097】当該技術分野の専門家はもちろん、それ自体無毒で、原則的には本発明に適しているであろうが、しかし環境又はその他の関連状況に対する受け入れ難い効果のために、排除されねばならないであろう噴射ガス（これらのガスは特にフルオロ炭化水素及びクロロフルオロ炭化水素（CFC）である）があることは知っている。

【0098】本発明による化粧品又は皮膚科学的調製物は、好適には、それぞれ該調製物の総重量を基にして、0.001-0.20重量%の、レチノール及び／又はそのエステル類

30

0.001-5.00重量%の、1種類以上の、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸及び／又は $\alpha$ -ケトカルボン酸、特にクエン酸、及び0.001-10.00重量%の、モノグリセロールモノカルボン酸モノエステル類、ジグリセロールモノカルボン酸モノエステル類及びトリグリセロールモノカルボン酸モノエステル類からなる群からの、1種類以上の物質を含んでなる。

40

【0099】それらは更に好適には、UVB域でUV光線を吸収する物質を含んでなり、そのフィルター物質の総量は、全領域の紫外線から皮膚を防護する、化粧品及び／又は皮膚科学的調製物を提供するためには、例えば、調製物の総重量を基にして0.1から30重量%、好適には0.5から10重量%、特には1から6重量%である。

【0100】本発明による乳剤がUVBフィルター物質を含んでなる場合、これらは油性又は水性であることができる。本発明により好都合な、油性UVBフィ

ルター物質は、例えば：

— 3-ベンジリデンカンファー誘導体、例えば3-(4-メチルベンジリデン)カンファー及び3-ベンジリデンカンファー；

— 4-アミノ安息香酸誘導体、例えば4-(ジメチルアミノ)安息香酸2-エチルヘキシル及び4-(ジメチルアミノ)安息香酸アミル；

— ケイ皮酸のエステル類、例えば4-メトキシケイ皮酸2-エチルヘキシル及び4-メトキシケイ皮酸イソペンチル；

— サリチル酸のエステル類、例えばサリチル酸2-エチルヘキシル、サリチル酸4-イソプロピルベンジル及びサリチル酸ホモメンチル；

— ベンゾフェノン誘導体、例えば2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、2-ヒドロキシ-4-メトキシ-4'-メチルベンゾフェノン及び2,2'-ジヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン；

— ベンザルマロン酸のエステル類、例えば4-メトキシベンザルマロン酸ジ- (2-エチルヘキシル)

— 2,4,6-トリアニリノー (p-カルボ-2'-エチル-1'-ヘキシルオキシ)-1,3,5-トリアジンである。

【0101】好都合な水溶性のUVBフィルター物質は、例えば：

— 2-フェニルベンズイミダゾール-5-スルホン酸の塩、例えばそのスルホン酸自体のみならず、そのナトリウム、カリウム又はそのトリエタノールアンモニウム塩；

— ベンゾフェノン類のスルホン酸誘導体、例えば、2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン-5-スルホン酸及びその塩類；

— 3-ベンジリデンカンファーのスルホン酸誘導体、例えば、4-(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル)-ベンゼンスルホン酸、2-メチル-5-(2-オキソ-3-ボルニリデンメチル)ベンゼンスルホン酸及びそれらの塩類である。

【0102】本発明による乳剤がUVAフィルター物質を含んでなる場合には、これらは、ジベンゾイルメタン誘導体、例えば、1-(4'-tert-ブチルフェニル)-3-(4'-メトキシフェニル)-プロパン-1,3-ジオン及び1-フェニル-3-(4'-イソプロピルフェニル)-プロパン-1,3-ジオンからなる群から、本発明により好都合に選ばれることができる。

【0103】本発明による調製物は又、UV光線から皮膚を防護するために化粧品中に通常使用される無機顔料を含んでなることができる。これらは、チタン、亜鉛、鉄、ジルコン、シリコン、マンガ、アルミニウム及びセリウムの酸化物及びそれらの混合物及び誘導体である。その顔料は二酸化チタンを基にしたものが特に好適である。

50

【0104】毛髪に覆われた皮膚に使用される、本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は、例えば、シャンプー組成物、シャンプーの前後、パーマメントウエーブ処理の前後又は毛髪の染色又は脱色の前後のすすぎの時に使用される調製物、毛髪のプロードライ又はセットのための調製物、染色、脱色用調製物、整髪及びトリートメント用ローション、毛髪用仕上げラッカー又はパーマメントウエーブ用組成物である。

【0105】適当な場合には、化粧品及び／又は皮膚科学的調製物は、毛髪の保護及び毛髪の処理のためのこの種類の調製物に通常使用されるような、補助剤及び／又は添加剤を更に含んでなる。使用される補助剤は、保存剤、界面活性物質、発泡抑制剤、乳化剤、増粘剤、脂肪、油、ワックス、有機溶媒、殺菌剤、香料、染料もしくは顔料（その仕事は毛髪又は化粧品又は皮膚科学的調製物自体を着色すること）、電解質及び、毛髪又は頭皮に油を回復させるための追加的物質、である。

【0106】本発明による、活性化化合物配合物の主成分を含む、本発明による水性の化粧品清浄剤、又は含水量の低いか、もしくは無水で、そして水による清浄を目的とした、本発明による清浄用組成物濃厚液は、陰イオン性、非イオン性及び／又は両性の界面活性剤、例えば

- 従来の石鹸、例えばナトリウムの脂肪酸塩
- 硫酸アルキル、硫酸アルキルエーテル及び硫酸アルカン-及びアルキルベンゼン
- スルホアセタート類
- スルホベタイン類
- サルコシナート類
- アミドスルホベタイン類
- スルホスクシナート類
- スルホコハク酸半エステル
- 炭酸アルキルエーテル類
- 蛋白-脂肪酸縮合物
- アルキルベタイン及びアミドベタイン類
- 脂肪酸アルカノールアミド類
- ポリグリコールエーテル誘導体

を含んでなることができる。

【0107】皮膚の化粧品清浄調製物である、化粧品調製物は、流体又は固体の形態にすることができる。それらは、好適には少なくとも1種類の陰イオン性、非イオン性もしくは両性の界面活性物質又はそれらの混合物、少なくとも1種類の本発明による電解質及び、この目的に通常使用されるような補助剤を含んでなる。界面活性物質は、清浄調製物中に、該調製物の総重量の1と94重量%の間の濃度で存在することができる。

【0108】シャンプー組成物である化粧品調製物は好適には、本発明による活性化化合物配合物の活性主成分に加えて、少なくとも1種類の陰イオン性、非イオン性又は両性の界面活性物質又はそれらの混合物、適当な場合には本発明による電解質及びこの目的に通常使用される

補助剤を含んでなる。該界面活性物質はシャンプー組成物中に、1重量%から94重量%の間の濃度で存在することができる。

【0109】化粧品又は皮膚科学的調製物は、すすぎ落され、そして、例えば脱色の前後、シャンプーの前後、2回のシャンプー段階の間又はパーマメントウエーブ処理の前後に使用される、ローションの形態にある場合には、それらは、例えば水性又は水性-アルコール性溶液であり、それらは場合によっては、界面活性物質、好適には非イオン性又は陽イオン性の界面活性物質を含有し、その濃度は0.1から10重量%、好適には0.2から5重量%にすることができる。これらの化粧品及び／又は皮膚科学的調製物は又この目的に通常使用される補助剤を含有するエアゾールにすることもできる。

【0110】すすぎ落とされないローション、特にヘアセット用ローション、毛髪のプロードライ時に使用されるローション又は整髪用及びトリートメント用ローションの形態にある化粧品調製物は、一般的に、水性、アルコール性又は水性-アルコール性溶液であり、そして少なくとも1種類の陽イオン性、陰イオン性、非イオン性又は両性のポリマー又はそれらの混合物、並びに本発明による活性化化合物配合物を含んでなる。使用されるポリマーの量は、例えば0.1から10重量%、好適には0.1と3重量%の間にある。

【0111】本発明による活性化化合物配合物を含んでなる、毛髪に覆われた皮膚の処理及び保護のための、本発明による化粧品調製物は、非イオン性又は陰イオン性タイプである乳剤の形態にすることができる。非イオン性乳剤は、水の他に、又、例えばポリエトキシ化もしくはポリプロポキシ化されることもできる油又は脂肪酸アルコール、あるいはそれらの2種の有機成分の混合物を含んでなる。これらの乳剤は、場合によっては陽イオン性界面活性剤を含んでなる。

【0112】本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は、このような調製物に通常使用されるような化粧品補助剤、例えば、保存剤、殺菌剤、香料、発泡抑制剤、染料、着色性をもつ顔料、増粘剤、界面活性物質、乳化剤、柔軟剤、湿潤剤及び／又は保湿剤、脂肪、油、ワックス又は、アルコール、ポリオール、ポリマー、気泡安定剤、電解質、有機溶媒又はシリコン誘導体のような、化粧品又は皮膚科学的調製物の、その他の従来の成分、を含んでなることができる。

【0113】前記化粧品及び／又は皮膚科学的調製物が溶液又はローションである場合は、使用することのできる溶媒は：

- 水又は水溶液；
- カプリン酸又はカプリル酸のトリグリセリドのような油類、しかし好適にはヒマシ油
- 脂肪、ワックス及びその他の天然に存在する、及び合成の脂肪物質、好適には脂肪酸と、低C数アルコー

ル、例えばイソプロパノール、プロピレングリコール又はグリセロールとのエステル、あるいは低C数のアルカン酸もしくは脂肪酸との脂肪酸アルコールのエステル；  
 一 低C数のアルコール、ジオール又はポリオール、及びそれらのエーテル、好適にはエタノール、イソプロパノール、プロピレングリコール、グリセロール、エチレングリコール、エチレングリコールモノエチルもしくはモノブチルエーテル、プロピレングリコールモノメチル、モノエチルもしくはモノブチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルもしくはモノエチルエーテル及び類似製品である。

【0114】前記の溶媒の混合物が特に使用される。アルコール性溶媒の場合には、水は追加的な成分になることができる。

【0115】爪の保護用の、本発明による乳剤は、例えば脂肪、油、ワックス及びその他の前記の脂肪物質、並びに水及び、このようなタイプの調製物に通常使用されるような乳化剤を含んでなる。

【0116】爪の保護及び／又は回復用の本発明によるゲル剤は、通常、低C数のアルコール、例えばエタノール、イソプロパノール、1, 2-プロパンジオール、グリセロール及び水、あるいは増粘剤の存在下での前記の油を含んでなり、その増粘剤は、好適には、油性-アルコール性ゲル剤の場合には二酸化ケイ素又はケイ酸アルミニウムであり、水性-アルコール性又はアルコール性ゲル剤の場合には好適にはポリアクリラートである。

【0117】その他の点では、当該技術分野の専門家がこれらの調製物に課す通常の要求事項及びそれらの成分が、このグループの化粧品及び／又は皮膚科学的調製物

#### UV非防御ゲルクリーム

相	原料	重量%
2	PPG14ブチルエーテル	4.00
1	グリセロール	3.00
2	ステアリルアルコール	2.00
2	メトキシケイ皮酸オクチル	2.00
2	ブチルメトキシジベンゾイルメタン	0.20
2	鉱油、DAB9	1.00
2	PPG1トリデセス-6	1.00
2	シクロメチコン	3.50
1	サリチル酸	2.00
1	GMC	0.50
1	DMC	1.00
2	ステアレス-21	1.50
2	ステアレス-2	1.50
1	NaOH	0.80
3	香料	適量
1	水	100.00に

相1及び2を別々の容器内で75-80℃に加熱し、その間にその固体は溶解される。それらの2相を混合した後、それらを65℃で均質化し、その乳剤を35℃に冷

に適用される。

#### 【0118】

【実施例】以下の実施例は、実施例の内容を限定する意図をもたずに、本発明を具体的に示すことを目的とされる。データの数字は特記されない限り、常に、具体的な調製物の総重量を基にした重量%である。

#### 【0119】(実施例1)

#### UV非防御ゲルクリーム

相	原料	重量%
2	PPG14ブチルエーテル	4.00
1	グリセロール	3.00
1	サリチル酸	2.00
2	ステアリルアルコール	2.00
2	鉱油、DAB9	1.00
2	PPG1トリデセス-6	1.00
2	シクロメチコン	3.50
1	GMC	0.50
1	DMC	1.00
2	ステアレス-21	1.50
2	ステアレス-2	1.50
1	NaOH	0.80
3	香料	適量
1	水	100.00に

に相1及び2を別々の容器内で75-80℃に加熱し、その間にその固体は溶解される。これらの2相を混合した後、それらを65℃で均質化し、その乳剤を35℃に冷却する。次いで相3を添加する。該混合物を30℃で再度均質化する。

#### 【0120】(実施例2)

相	原料	重量%
2	PPG14ブチルエーテル	4.00
1	グリセロール	3.00
2	ステアリルアルコール	2.00
2	メトキシケイ皮酸オクチル	2.00
2	ブチルメトキシジベンゾイルメタン	0.20
2	鉱油、DAB9	1.00
2	PPG1トリデセス-6	1.00
2	シクロメチコン	3.50
1	サリチル酸	2.00
1	GMC	0.50
1	DMC	1.00
2	ステアレス-21	1.50
2	ステアレス-2	1.50
1	NaOH	0.80
3	香料	適量
1	水	100.00に

却する。次いで相3を添加する。該混合物を30℃で再度均質化する。

#### 【0121】(実施例3)

19

## 顔面保護ゲル剤、透明

相	原料	重量%
1	PEG150	1.00
1	ブチレングリコール	8.00
1	カルボマー	1.00
2	NaOH	0.70
1	乳酸	2.00
1	GMC	0.50
1	DMC	1.00

## カバーアップクリーム

相	原料	重量%
2	PEG12	4.00
1	ブチレングリコール	5.00
2	ステアレス-2	2.00
3	TiO <sub>2</sub>	19.00
2	ミリスチルアルコール	2.50
1	アクリラート/C <sub>10-30</sub> -アルキル アクリラートコポリマー	0.50
1	カルボマー	0.30
1	GMC	0.50
1	DMC	1.00
1	保存剤	適量
3	香料	適量
1	水	100.00に

相1及び2を別々の容器内で75-80℃に加熱し、その間にその固体は溶解される。これらの2相を混合した後、それらを65℃で均質化し、その乳剤を35℃に冷

## UV非防御O/Wローション

相	原料	重量%
2	カプリル/カプリン酸トリグリセリド	2.00
2	鉱油DAB9	1.00
1	ソルビトール	3.00
2	セテアリルアルコール	2.00
2	セテアレス-20	1.50
2	セテアレス-12	1.50
1	サリチル酸	2.00
1	GML	0.50
1	DML	1.00
1	カルボマー	0.30
3	NaOH	0.80
4	保存剤	適量
4	香料	適量
1	水	100.00に

相1及び2を別々の容器内で75-80℃に加熱し、その間にその固体は溶解される。これらの2相を混合した後、該混合物を絶えず攪拌しながら相3で中和する。該混合物を65℃の相温度で均質化し、その乳剤を35℃

## UV非防御O/Wローション

相	原料	重量%
2	カプリル/カプリン酸トリグリセリド	2.00

20

1	マンサク抽出液	2.00
1	保存剤	適量
3	香料	適量
1	水	100.00

に相1を75-80℃で溶解すると、透明な溶液が生成され、そして相2を添加しながら、ゆっくり攪拌する。生成されたゲルを絶えず攪拌しながら、35℃に冷却し、そして相3を添加する。

【0122】(実施例4)

却する。次いで相3を添加する。該混合物を30℃で再度均質化する。

## 【0123】(実施例5)

に冷却する。次いで相4を添加する。該混合物を30℃で再度均質化する。

## 【0124】(実施例6)

21

2	鉱油DAB9	1.00
2	メトキシケイ皮酸オクチル	2.00
2	ブチルメトキシジベンゾイルメタン	
1	ソルビトール	3.00
2	セテアリルアルコール	2.00
2	セテアレス-20	1.50
2	セテアレス-12	1.50
1	サリチル酸	2.00
1	GML	0.50
1	DML	1.00
1	カルボマー	0.30
3	NaOH	0.80
4	保存剤	適量
4	香料	適量
1	水	100.00に

相1及び2を別々の容器内で75-80℃に加熱し、その間にその固体は溶解される。これらの2相を混合した後、該混合物を絶えず攪拌しながら相3で中和する。該混合物を65℃の相温度で均質化し、その乳剤を35℃に冷却する。次いで相4を添加する。該混合物を30℃で再度均質化する。

## 【0125】(実施例7)

## UV非防御着色ゲルクリーム

相	原料	重量%
2	シクロメチコン	5.00
1	セテアレス-20	2.00
1	ブチレングリコール	5.00
2	セテアリルアルコール	2.00
1	キサンタンゴム	0.40
2	カルボマー	0.80

## UV非防御ゲルクリーム

相	原料	重量%
2	シクロメチコン	5.00
1	セテアレス-20	2.00
1	ブチレングリコール	5.00
2	セテアリルアルコール	2.00
1	キサンタンゴム	0.40
2	カルボマー	0.80
2	メトキシケイ皮酸オクチル	2.00
2	ブチルメトキシジベンゾイルメタン	0.20
1	サリチル酸	2.00
1	GML	0.50
2	DML	1.00
3	NaOH	0.80
4	TiO <sub>2</sub>	0.35
4	着色された顔料	適量
5	香料	適量
1	水	100.00に

相1及び2を別々の容器内で75-80℃に加熱し、その間にその固体は溶解される。これらの2相を混合した

22

1	サリチル酸	2.00
1	GML	0.50
1	DML	1.00
3	NaOH	0.80
4	TiO <sub>2</sub>	0.35
4	着色顔料	適量
5	香料	適量
1	水	100.00

に相1及び2を別々の容器内で75-80℃に加熱し、その間にその固体は溶解される。これらの2相を混合した後、該混合物を絶えず攪拌しながら相3で中和する。ついで相4を振り入れる。該混合物を65℃の相温度で均質化し、その乳剤を35℃に冷却する。次いで相5を添加する。該混合物を30℃で再度均質化する。

## 【0126】(実施例8)

後、該混合物を絶えず攪拌しながら相3で中和する。ついで相4を振り入れる。該混合物を65℃の相温度で均

23

質化し、その乳剤を35℃に冷却する。次いで相5を添加する。該混合物を30℃で再度均質化する。

## 【0127】(実施例9)

アクネ用顔面ローション、アルコール非含有

相	原料	重量%
1	レシチン	1.00
1	水	15.00
2	GMC	0.50
2	DMC	1.00
2	ブチレングリコール	4.00 10

アクネ用顔面ローション、アルコール非含有

相	原料	重量%
1	レシチン	1.00
1	水	15.00
2	GML	0.50
2	ブチレングリコール	4.00
2	ラウレス硫酸ナトリウム	4.00
2	乳酸	2.00
3	香料	適量
3	水	100.00に

相2を混合し、そして60℃に加熱し、そして次いで50℃に冷却する。次いで相1を攪拌しながらゆっくり添加する。この相混合物を35℃に冷却し、次いで相3を

アクネ用顔面ローション、アルコール含有

相	原料	重量%
1	GMC	0.50
1	DMC	1.00
1	ブチレングリコール	4.00
1	硫酸ラウレスナトリウム	4.00
1	水	100.00に
2	エタノール	20.00
2	サリチル酸	2.00
2	パルミチン酸レチニル	0.40
2	香料	適量

サリチル酸及びパルミチン酸レチニルをアルコールに完全に溶解し、必要なら香料を添加する(相2)。相1の成分を60℃に加熱し、攪拌する。35℃に冷却後、相

アクネ用顔面ローション、アルコール含有

相	原料	重量%
1	GMC	0.50
1	DMC	1.00
1	ブチレングリコール	10.00
1	硫酸ラウレスナトリウム	2.00
1	水	100.00に
2	エタノール	10.00
2	乳酸	2.00
2	パルミチン酸レチニル	0.40
3	レシチン	1.00
3	水	15.00
2	香料	適量

24

2	ラウレス硫酸ナトリウム	4.00
2	乳酸	2.00
3	香料	適量
3	水	100.00

に相2を混合し、そして60℃に加熱し、そして次いで50℃に冷却する。次いで相1を攪拌しながらゆっくり添加する。この相混合物を35℃に冷却し、次いで相3を攪拌しながら添加する。

## 【0128】(実施例10)

攪拌しながら添加する。

## 【0129】(実施例11)

2を攪拌しながら添加する。

## 【0130】(実施例12)

乳酸及びパルミチン酸レチニルをアルコールに完全に溶解し、次いで必要なら香料を添加する(相2)。相1の成分を60℃に加熱し、攪拌する。50℃に冷却後、相

アクネ用顔面ローション、アルコール含有

相	原料	重量%
1	DML	1.50
1	ブチレングリコール	10.00
1	硫酸ラウレスナトリウム	2.00
1	水	100.00に
2	エタノール	10.00
2	乳酸	2.00
2	パルミチン酸レチニル	0.40
3	レシチン	1.00
3	水	15.00
2	香料	適量

乳酸及びパルミチン酸レチニルをアルコールに完全に溶解し、次いで必要なら香料を添加する(相2)。相1の成分を60℃に加熱し、攪拌する。50℃に冷却後、相3を添加する。更に30℃に冷却後、相2を攪拌しながら添加する。

【0132】本発明の特徴と態様を以下に示す。

【0133】1. 化粧品用及び/又は皮膚科学的活性化化合物配合物であって、

a) 活性量のサリチル酸及び/又は活性量の、1種類以上の $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸及び/又は活性量の、1種類以上の $\alpha$ -ケトカルボン酸、

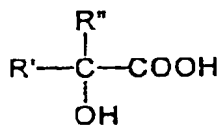
b) モノグリセロールモノカルボン酸モノエステル類、ジグリセロールモノカルボン酸モノエステル類及びトリグリセロールモノカルボン酸モノエステル類からなる群から選ばれる1種類以上の物質及び

c) 適当な場合には、活性量の、レチノール及び/又はレチノール誘導体を含んでなる配合物。

【0134】2. 前記 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸もしくは $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸類が、一般式

【0135】

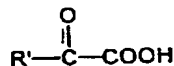
【化20】



【0136】の物質からなる群から選ばれること、及び前記 $\alpha$ -ケトカルボン酸もしくは $\alpha$ -ケトカルボン酸類が、一般式

【0137】

【化21】



【0138】の物質からなる群から選ばれることを特徴とし、上記式中、 $R'$  及び $R''$  はたがいに独立してそれぞれ、(a1) H-、(a2) 分枝又は非分枝 $C_{1-25}$ -

3を添加する。更に30℃に冷却後、相2を攪拌しながら添加する。

【0131】(実施例13)

アルキル-、(a3) 1個以上のカルボキシル基及び/又はヒドロキシル基及び/又はアルデヒド基及び/又はオキシ基(ケト基)により置換されている、分枝又は非分枝の $C_{1-25}$ -アルキル-、(a4) フェニル-、(a5) 1個以上のカルボキシル基及び/又はヒドロキシル基及び/又は分枝及び/又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル基により置換されているフェニル-か、あるいはここで、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸の $\alpha$ -炭素原子が、 $R'$  及び $R''$  と一緒になって、(a6) 3から7個の環原子をもつ非置換シクロアルキル基を形成するフェニル-か、又は(a7) 3から7個の環原子をもち、そして1個以上の、カルボキシル基及び/又はヒドロキシル基及び/又はオキシ基(ケト基)及び/又は分枝及び/又は非分枝 $C_{1-25}$ -アルキル基により置換されており、そしてここで、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸もしくは $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸類又は $\alpha$ -ケトカルボン酸もしくは $\alpha$ -ケトカルボン酸類は、場合によっては、それらの生理学的に許容性のある塩類及び/又はエチルエステル類及び/又はメチルエステル類の形態であることができる、上記1による活性化化合物配合物。

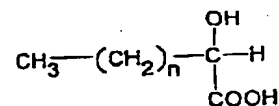
【0139】3. 前記 $\alpha$ -ヒドロキシ酸が、 $\alpha$ -ヒドロキシ-脂肪酸、 $\alpha$ -ヒドロキシ-糖酸、脂肪族 $\alpha$ -ヒドロキシ-果実酸、非置換芳香族 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸及び置換芳香族 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸からなる群から選ばれることを特徴とする、第1項による活性化化合物配合物。

【0140】4. 前記 $\alpha$ -ヒドロキシ酸が、

一 式

【0141】

【化22】



【0142】による、 $\alpha$ -ヒドロキシカルボン酸及び/

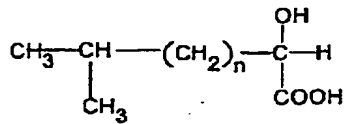
27

又は

— 式 —

【0143】

【化23】

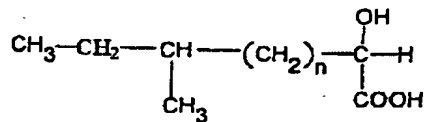


【0144】による、 $\alpha$ -ヒドロキシイソカルボン酸及び／又は

— 式 —

【0145】

【化24】



【0146】式中、 $n$ はそれぞれ7から31の数字であるによる、 $\alpha$ -ヒドロキシアンテイソカルボン酸及び—アルドン酸、アルダル酸、ウロン酸、グリセリン酸、リンゴ酸、乳酸、酢酸及びクエン酸からなる群から選ばれることを特徴とする、第1項による活性化合物配合物。

【0147】5. 前記モノグリセロールモノカルボン酸モノエステル類、ジグリセロールモノカルボン酸モノエステル類及びトリグリセロールモノカルボン酸モノエ

28

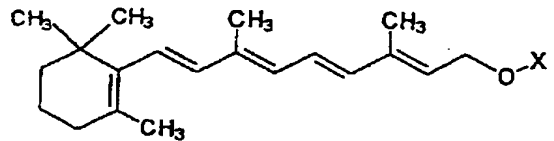
テルからなる群からの物質(類)が、モノカプリル酸グリセロール、モノカプリン酸グリセロール、モノカプリン酸ジグリセロール、モノラウリル酸トリグリセロール、モノラウリル酸ジグリセロール及びモノミリスチン酸トリグリセロールからなる群から選ばれることを特徴とする、第1項による活性化合物配合物。

【0148】6. 前記レチノール誘導体が、以下の構造

【0149】

【化25】

10



【0150】ここで、 $X$ は好適には、1から25個のC原子をもつ、分枝又は非分枝の、アルキル基又はアルケニル基であるの物質からなる群から選ばれることを特徴とする、第1項による活性化合物配合物。

20

【0151】7. パルミチン酸レチノール(=パルミチン酸レチニル)が前記レチノールエステルとして選ばれることを特徴とする、第1項による活性化合物配合物。

【0152】8. 斑点のある皮膚、軽症の形態のアクネ及びアクネプロピオン酸菌(*Propionibacterium acnes*)防除のための、第1項による活性化合物配合物の使用。

フロントページの続き

(51)Int.Cl. <sup>6</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K	31/19	A D Z	A 6 1 K	31/19
	31/215			31/215
	31/60	A D A		31/60
(72)発明者	フロリアン・ボルフ		(72)発明者	ミヒヤエル・クリステイアンゼン
	ドイツ・デー—20251ハンプルク・フズマ			ドイツ・デー—25463トルネツシュ・ピナ
	ーシュトラレーセ2			ウリング63
(72)発明者	ベルント・トラウベ		(72)発明者	ジクリート・シュタインケ
	ドイツ・デー—22457ハンプルク・クラウ			ドイツ・デー—21075ハンプルク・ミルヒ
	スーナンネーシュトラレーセ61			グルント84